### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# - I NEBER BUNDER IN BLEINE HICH BEICH BEICH BISCH EIN AUCH BORRE BURGE HUNG LEBEN SIED BEFERLU IBER HER LEBE L

(43) 国際公開日 2005 年1 月20 日 (20.01.2005)

**PCT** 

# (10) 国際公開番号 WO 2005/005371 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 227/32, 229/22, 229/28, C07B 53/00, B01J 31/24

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/009829

(22) 国際出願日:

2004年7月9日(09.07.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-272637 2003年7月10日(10.07.2003) JP 特願2003-426226

2003年12月24日(24.12.2003) JP

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 3 丁目 7番地 1 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 濱田 康正 (HAMADA, Yasumasa) [JP/JP]; 〒2630022 千葉県千葉市稲毛区弥生町 1-3 3 Chiba (JP). 牧野 一石 (MAKINO, Kazuishi) [JP/JP]; 〒2630024 千葉県千葉市稲毛区穴川 3-1 1-7 8 ハイムシイナ 1 0 7 Chiba (JP).

(74) 代理人: 萼 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.); 〒 1010062 東京都千代田区神田駿河台 3 丁目 2 番地 新御茶ノ水アーパントリニティ 萼特許事務所内 Tokyo (JP).

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, E, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCTION OF OPTICALLY ACTIVE  $\beta$ -HYDROXY- $\alpha$ -AMINOCARBOXYLIC ACID DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 光学活性 eta –ヒドロキシ–lpha–アミノカルポン酸誘導体の製造方法

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a process for efficient production of optically active  $\beta$ -hydroxy- $\alpha$ -aminocarboxylic acid derivatives of anti conformation useful as intermediates of drugs or agricultural chemicals. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] A process for the production of optically active  $\beta$ -hydroxy- $\alpha$ -aminocarboxylic acid derivatives represented by the general formula (2) or (3): [wherein  $R^1$  is substituted or unsubstituted  $C_{1\cdot 20}$  alkyl or a substituted or unsubstituted or unsubstituted  $C_{1\cdot 20}$  alkyl or a substituted or unsubstituted or unsubstituted  $C_{1\cdot 20}$  alkyl or a substituted or unsubstituted or unsubstituted  $C_{1\cdot 20}$  alkyl or a substituted or unsubstituted or

represented by the general formula (1): [wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are each as defined above] through catalytic asymmetric hydrogenation in the presence of an acid.

#### (57) 要約:

### 【要約】

【課題】医・農薬の中間体として有用である光学活性 βーヒドロキシー αーアミノカルボン酸誘導体のアンチ体の効率的な製造方法を提供する。

## 【解決手段】式(1)

# 【化45】

$$\begin{array}{c}
O \\
R^1 \\
\hline
NH_2
\end{array}$$
(1)

[式中、 $R^1$ は、置換若しくは無置換の $C_{1-20}$ アルキル基又は置換若しくは無置換の $C_{4-12}$ 芳香族基を意味し、 $R^2$ は、置換若しくは無置換の $C_{1-20}$ アルキル基又は置換若しくは無置換の $C_{4-12}$ 芳香族基を意味する。]で表される $\alpha$ -アミノアシル酢酸エステル化合物を、酸の存在下において、触媒的不斉水素化反応により水素化することを特徴とする、式(2)又は式(3)

## 【化46】

[式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、前記と同じ意味を示す。]で表される光学活性  $\beta$  —ヒドロキシー  $\alpha$  —アミノカルボン酸誘導体の製造方法。

#### 【選択図】 なし